

簡介特殊口服劑型

許家禎

口服是最方便的給藥方式，口服劑型包括錠劑、膠囊、溶液劑及粉劑等。每一種藥品的劑型設計必須考量藥物本身物理化學性質、藥物動力學、藥效學、使用族群及服藥順從性等。其中錠劑與膠囊可被設計成口服特殊劑型，例如腸溶劑型之設計可減少藥物在胃中受到胃酸破壞，或降低對胃及食道黏膜的刺激；持續藥效劑型（錠劑或膠囊）之設計可減少藥物血中濃度的波動、延長療效時間、降低副作用、減少給藥次數及增進服藥依從性等。

腸溶劑型或稱腸衣劑型是在藥的表面包覆「腸衣」，使得藥物在胃中不會崩解釋出，而必須在偏鹼環境的小腸才崩解釋出，此可避免藥物刺激胃及食道黏膜或受到胃酸的破壞。若將腸溶劑型剝半或磨粉會造成消化道不適，且降低藥效。例如非類固醇消炎止痛劑 Voren[®] (非炎腸溶微粒膠囊, diclofenac)，其有效成份 diclofenac 會直接傷害胃部引起胃部不適，因此研發製成腸溶劑型，使藥品到達小腸才溶離釋放出有效成份，以避免在胃部溶解、減少對胃部的傷害。制酸劑會中和胃酸、提高胃部 pH 值，使得腸溶劑型在胃部就開始溶離，因此若腸溶劑型與制酸劑同時服用，藥品主成份會在胃中就釋出，即失去腸溶劑型之設計目的，因此腸溶劑型與制酸劑的服藥時間應間隔至少 2 小時為宜。Dulcolax[®] (樂可舒腸溶錠, bisacodyl) 藉由刺激腸道神經叢而為峻瀉劑，臨床用以治療便秘，製成腸溶錠可使藥物到達腸道再開始作用，減少對上消化道（食道黏膜、胃黏膜）的刺激，若將樂可舒腸溶錠磨粉使用，則會增加胃部不適及絞痛等副作用。用於消腫的藥物 Danzen[®] (達先腸溶錠, serratiopeptidase)，其成份為酵素，若將此腸溶劑型磨粉服用，將造成有效成份在胃中被破壞，而無法達到療效。

持續藥效劑型或稱長效劑型、緩釋劑型、控制釋放劑型等，此劑型之設計可控制藥物的釋放速率及釋放部位等，在設計時間內均可達到效用。製造持續藥效劑型的技術原理包括將含藥的小顆粒包衣、微膠囊包覆、多層錠片、將藥埋入惰性基質或親水性基質、形成複合物、滲透壓幫浦等。因持續藥效劑型的製造方法不同，是否可剝半使用或供鼻胃管灌食患者使用需視劑型設計而定。例如可用於降血壓的 verapamil，由於此成份在體內藥效較短，一天需要服用 3 次方可達到持續降壓的效果，長期每日多次服藥易降低患者服藥依從性，因此將一天總劑量設計製成 Isoptin[®] 心舒平持續性膜衣錠，一天服藥一次即可達到 24 小時持續降壓的效果；若將此持續錠咬碎或磨粉服用，會使得全部有效藥物在短時間內吸收及作用，造成血壓驟降甚至引起生命危險。Theophylline 用於擴張支氣管，一般每日需服用 3-4 次，且其治療濃度範圍狹窄，故製成 Xanthium[®] 善寧持續性藥效膠囊，可每日服藥 1-2 次，且避免因血中濃度過高造成的副作用及血中濃度過低造成的療效不足。某些持續藥效錠服用後可能會排出藥物空殼，此時不必擔心，因為裡面的藥品已在病人腸道釋放吸收，排出的僅是無法分解吸收的藥物外殼，例如降血壓藥物 Adalat[®] OROS (冠達悅歐樂持續藥效錠, nifedipine)。

經由上述的介紹，您是否對腸溶劑型及持續藥效劑型有概念了呢？特殊劑型均為特殊

目的而設計，故不能破壞劑型，但遇吞服困難或僅需一半劑量時該怎麼辦呢？在此特別提醒，特殊劑型之錠劑有些可剝半有些不可剝半，膠囊有些可打開外殼直接服用其內小顆粒，有些不可打開外殼，但全部的特殊口服劑型均不可磨粉。每個特殊劑型的用藥須知在台北榮總藥袋均有標示，另由本院網站首頁「民眾用藥資訊」專區亦可查詢。